

**(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG**

**(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro**



PCT

**(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
27. Januar 2005 (27.01.2005)**

**(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/007139 A3**

- (51) Internationale Patentklassifikation⁷:** **A61K 9/26**
- (21) Internationales Aktenzeichen:** PCT/EP2004/007882
- (22) Internationales Anmeldedatum:**
15. Juli 2004 (15.07.2004)
- (25) Einreichungssprache:** Deutsch
- (26) Veröffentlichungssprache:** Deutsch
- (30) Angaben zur Priorität:**
103 32 160.8 15. Juli 2003 (15.07.2003) DE
- (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US):** RÖHM GMBH & CO. KG [DE/DE]; Kirschenallee, 64293 Darmstadt (DE).
- (72) Erfinder; und**
- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US):** LIZIO, Rosario [IT/DE]; Rossbergweg 7L, 64380 Rossdorf (DE). PETEREIT, Hans-Ulrich [DE/DE]; Händelstrasse 40, 64291 Darmstadt (DE). ROTH, Erna [DE/DE]; Eberstädter Kirchstrasse 5, 64297 Darmstadt (DE). DE ANDRES, Inés [ES/BE]; Rue de Medaets 63, B-1150 Woluwe St. Pierre (BE). DAMM, Michael [DE/DE]; Dieburger Strasse 106, 63322 Rödermark (DE).
- (81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart):** AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart):** ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
- Veröffentlicht:**
— mit internationalem Recherchenbericht
- (88) Veröffentlichungsdatum des Internationalen Recherchenberichts:** 12. Mai 2005

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: MULTIPARTICLE PHARMACEUTICAL DOSAGE FORM CONTAINING A MUCOADHESIVELY FORMULATED PEPTIDE OR PROTEIN ACTIVE SUBSTANCES METHOD FOR PRODUCING SAID PHARMACEUTICAL DOSAGE FORM

(54) Bezeichnung: MULTIPARTIKULÄRE ARZNEIFORM, ENTHALTEND MUCOADHAESIV FORMULIERTE PEPTID-ODER PROTEIN-WIRKSTOFFE, SOWIE EIN VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG DER ARZNEIFORM

(57) Abstract: The invention relates to an oral, multiparticle pharmaceutical dosage form containing pellets, the size of which ranges from 50 to 2500 µm and which essentially consist of: a) an inner matrix layer containing an active substance which is a peptide or a protein, including the derivatives or conjugates thereof, and which is embedded in a matrix consisting of a polymer with mucoadhesive effect, and b) an outer film coating essentially consisting of an anionic polymer or copolymer, which can be optionally formulated with pharmaceutically conventional adjuvants, more particularly softening agents.

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft eine orale, multipartikuläre Arzneiform, enthaltend Pellets mit einer Größe im Bereich von 50 bis 2500 µm, die im wesentlichen aufgebaut sind aus a) einer inneren Matrix-Schicht, enthaltend einen Wirkstoff, der ein Peptid oder ein Protein einschließlich deren Derivate oder Konjugate ist und in eine Matrix aus einem Polymeren mit mucoadhaesiver Wirkung eingebettet ist, und b) einem äußeren verfilmten Überzug, bestehend im wesentlichen aus einem anionischen Polymer oder Copolymer, das optional mit pharmazeutisch üblichen Hilfsstoffen, insbesondere Weichmachern, formuliert sein kann.

WO 2005/007139 A3